

(11)Publication number : 55-111411
(43)Date of publication of application : 28.08.1980
(21)Application number : 54-018753
(22)Date of filing : 19.02.1979

(71)Applicant : SANSHO SEIYAKU KK

(72)Inventor : HONDA GORO

(54) : COSMETIC FOR MAKING FAIR SKIN

(57) : Abstract:

PURPOSE: A cosmetic for making fair skin that contains a flavonol analog as an effective component, thus showing strong activities of making fair skin and preventing sunburn.

CONSTITUTION: Said cosmetic for making fair skin contains 0.01W10wt% of a flavonol analog of the formula (R1, R2, and R4 are H, hydroxyl, methoxy; R3, R5, and R6 are H, hydroxyl), e.g., myricetin, rhamnetin, however, quercetin is excluded). The compounds of the formula, themselves, have strong activity of inhibiting tyrosinase activity and further high oxidation resistance and ultraviolet absorption. Therefore, the cosmetic increases the stabilities to light and pH and shows extremely high storage stability. It is harmless to human bodies at all. The compounds of the formula, the effective component, is obtained by reaction between a corresponding flavanone, amyl nitrite and hydrochloric acid, and hydrolyzing the resulting isonitroso derivative with an acid. These compounds are required to have a hydroxyl group in the 3-position.

⑩ 日本国特許庁 (JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55-111411

⑬ Int. Cl.³
A 61 K 7/00
7/42

識別記号

府内整理番号
7432-4C
6755-4C

⑭ 公開 昭和55年(1980)8月28日
登録の数 1
審査請求 有

(全 5 頁)

⑮ 色白化粧料

福岡県筑紫郡太宰府町大字大佐野

⑯ 特願 昭54-18753
⑰ 出願 昭54(1979)2月19日
⑱ 発明者 本田五郎

⑯ 出願人 三省製薬株式会社

大野城市大字筒井1丁目6番地

⑰ 代理人 弁理士 朝日奈宗太

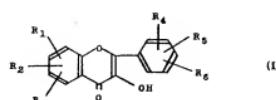
明細書

1 発明の名称

色白化粧料

2 各種請求の範囲

1 一般式(D)



{式中、R₁、R₂およびR₄はH、OHまたはOCOR₃、R₃、R₅およびR₆はHまたはOHである}を有するフラボノール系化合物(ただし、ケルセチンを除く)を有効成分とする色白化粧料。

2 フラボノール系化合物の含有量が0.01~10重量%である各種請求の範囲第1項記載の化粧料。

3 発明の詳細な説明

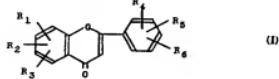
本発明は新規な色白化粧料に関する。さらに詳しくは、フラボノール系化合物を有効成分として含有せしめた美白効果および日焼防止効果の大なる色白化粧料に関する。

色白の美しい肌にしたいと願うのは女性の常であり、従来より過酸化水素、過酸化亜鉛、過酸化マグネシウム、過酸化ナトリウム、過ホウ酸亜鉛、過ホウ酸マグネシウムまたは過ホウ酸ナトリウムなどの過酸化物を配合した化粧料が広く使用されていた。しかししながら既記のとおり過酸化物は保存性、物理的または化学的安定性あるいは化粧料への配合性の面で問題があり、かつその美白効果も充分ではなかつた。近年になって、ビタミンC、システイン、コロイド銀などを配合した化粧料が開発され実用されているが、これらとてもなお充分に満足しうる保存性、安定性および美白効果を有するものとはいいがたい。

これに対し本発明者は、さきにフラボノール

系であるクエルセチンがその美白効果および日焼防止効果にすぐれた活性を有しているという新たな事実を見出し、特許出願（特願昭53-1655303号）をしたが、さもなく本発明者は既往研究を重ねた結果、他のフラボノール系化合物が前記クエルセチンと同様に人体皮膚内に存在するチロジナーゼの活性を阻害して色素をメラニン生成抑制作用を示すと共に、すぐれた抗酸化作用や紫外線吸収作用を示し、そのためすぐれた美白効果および日焼防止効果を有し、さらにこのものはクエルセチンと同様にpH、光、熱などに対する安定性が大きく保存性がすぐる良好であるなどの効果を発揮するという新たな事実を見出し、本発明を完成するにいたつた。

すなわち本発明は、一般式(I)：



(B)

トキシーフラボノールなどがあげられ、これら化合物は1種または2種以上を混合して使用される。

これらの化合物は、たとえば相当するフラボン系化合物に還元剤アミルと強酸を反応させ、えられたイソニトリソケート体を酸で加水分解する方法 (St.-T.Kostanecki et al., Ber., 37, 773, 1402 (1904) および小沢光ら、楽研、71, 1185 (1951)) を利用して生成される。

本発明におけるフラボノール系化合物に類似する化合物としては、前記一般式(I)において3位に水酸基を有しないフラボン系化合物があげられるが、かかるフラボン系化合物はインビトロにおいてチロジナーゼ活性阻害能力を殆んど有しないものである。また前記フラボノール系化合物において、3位の水酸基で配體となるればあい（たとえばルテン、クエルシトリンなど）も、同様に殆どチロジナーゼ活性阻害能力を有しない。

本発明における前記フラボノール系化合物は

特開昭55-1111411 (2)

（式中、R₁、R₂およびR₄はH、OHまたはOOH₃、R₃、R₅およびR₆はHまたはOHである）を有するフラボノール系化合物（ただし、クエルセチンを除く）を有効成分とする色白化粧料を提供するものである。

すなわち本発明の色白化粧料はその有効成分としてクエルセチンを除くフラボノール系化合物を含有せしめたものである。

かかるフラボノール系化合物はそれ自体強力なチロジナーゼ活性阻害能力を有し、かつすぐれた抗酸化作用や紫外線吸収作用を有すると共に、光、pHに対する安定性が増加して保存安定性がきわめて良好であるなどのすぐれた美白効果および日焼防止効果を発揮すると共に、人体に対してまつたく無害である。

本発明における前記一般式(I)を有するフラボノール系化合物の具体例としては、たとえば從来公知のミリセチン、ラムネチン、ロビネチン、クリソスブレキチン、ダテスセチン、ファセチン、ガランギン、ヘルベセチン、5-,7-ジメ

(C)

その3位に水酸基を有しており、そのためその2、5および4位においておそらくケト-エノール形の互変異性をとり、かつきわめて複雑な共鳴現象を起しているものと考えられる。しかして本発明におけるフラボノール系化合物は、その3位に水酸基を有していることによる前述のごとき現象によつて、強力にチロジナーゼ活性を阻害するものと考えられる。

本発明の色白化粧料は適度の化粧料基材にかかるフラボノール系化合物を含有せしめたものであるが、該フラボノール系化合物の含有量としては通常0.01～10%程度、をかんべく0.05～0.5%程度の範囲が採用される。ただし、かかる範囲内で充分に満足しうる美白効果、日焼防止効果が実現されるのであって前記範囲より多量に含有せしめるとときはそれに見合う実益がともなくわらず、一方前記範囲より少なく含有せしめるときは美白効果、日焼防止効果の面で若干の不安が残るからである。

以上述べたごく本発明の色白化粧料は、美

(D)

白剤および日焼防止剤としてラボノール系化合物を含有せしめることにより、従来品の欠点を克服したるものであつて、用いる化粧料基材などによつて何ら制限されるものではない。したがつて本発明においては、化粧料基材として従来より多用されている種々の基礎化粧料基材、れとえば各種アルコール類、動植物脂肪、界面活性剤、ベクチン、カルボキシメチルセルロース、アルギン酸塩、さらには安定剤、色素、香料およびその他の成分を適量配合し、要すれば加熱溶解または溶融混拌したものなどをすべてそのまま採用可能である。

つぎに実施例、比較例および処方例をあげて本発明の色白化粧料を説明する。

実施例 1 ~ 10

次表に示す各ラボノール系化合物をそれぞれエタノールに溶解し、コハク酸あるいは炭酸カリウムでpHを6.0に調整して次表に示す濃度を有する各リニメント剤を作た。

(A)

(B)

て、57%の氷水槽中で10分間インキュベー^トしたもの、これにチロジナーゼ溶液(1mg/ml)を0.1ml加えてよく攪拌し、ただちに分光光度計にセットじて475nmにおける吸光度を絶対的に測定した。一方、プランクトンとして前記リニメント剤の代わりに水を用いて同様の吸光度測定を行なつた。

比較例 1 および 2

ラボノール系化合物に代えてラボン系化合物であるラボンおよびルテオリンをそれぞれ用いた場合は実施例1と同様にして濃度0.25%の各リニメント剤を調製し、それらのチロジナーゼ活性阻害能力を調べた。

比較例 3

ラボノール系化合物に代えてルチンを用いた場合は実施例1と同様にして濃度0.5%のリニメント剤を調製し、そのチロジナーゼ活性阻害能力を調べた。

前記実施例1および比較例1~3における各試験結果を添付図面(グラフ)に示す。このダ

実施例番号	ラボノール系化合物	リニメント剤中の濃度(%)
1	ミリセチン	0.25
2	ラムネチン	0.25
3	ロビネチン	0.20
4	クリソスプレネチン	0.30
5	ダチスセチン	0.20
6	アイセチン	0.25
7	ガランギン	0.25
8	ヘルバセチン	0.25
9	5,7-ジメチルヘキサノール	0.25
10	{ミリセチンとダチスセチンとの混合比で1:1の混合物}	0.25

かくしてえられた各リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能力を調べた結果をつぎに説明する。

試験管にユーチロジン溶液(0.5mg/ml)を1ml、マツタルペイン氏の緩衝液(pH6.8)を1ml、および前記リニメント剤の0.9mlを加え

テから実施例1でえたリニメント剤は比較的1~3でえた各リニメント剤に比べて顯著なチロジナーゼ活性阻害能を有していることがわかる。また実施例2~10でえた各リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能は実施例1でえたリニメント剤のそれとはほぼ同じであった。

つぎに本発明の色白化粧料の処方例を列挙するが、本発明はもとよりこれらの処方例のみに限定されるものではない。

処方例 1 [ローション]

(成 分)	(重量部)
ミリセチン	0.10
アミノ酸類	0.20
塩酸ビリドキシン	0.05
フェノールスルホン酸鉄銅	0.30
プロビデンジコール	8.00
エタノール	5.00
精製水	86.35
香料および防腐剤	少 量

処方例 2 [バスク]

(C)

(D)

(成 分)	(重量部)	(成 分)	(重量部)
フイセチン	0.10	プロピレングリコール	6.00
ステアリン酸	4.00	エタノール	10.00
アミノ酸	0.20	精製水	69.70
エノールスルホン酸亜鉛	0.50	香料および防腐剤	少 量
プロピレングリコール	15.00	地 方 例 4 [ミルクローション]	
カルボキシビニルポリマー	1.20	(成 分)	(重量部)
水溶性ナトリウム	0.14	フイセチン	0.20
エタノール	2.50	ステアリン酸	2.00
硬化チタン	0.02	セタノール	0.50
精製水	82.54	ラノリン	2.00
香料および防腐剤	少 量	オレイルオレエート	2.00
地 方 例 5 [パック]		スクワラン	5.00
(成 分)	(重量部)	流動ペラフィン	8.00
ダチスセチン	0.10	乳化剤	2.60
ポリビニルアルコール	15.00	トリエタノールアミン	1.00
ポリビニルビロリドン	4.00	プロピレングリコール	4.00
ステアリン酸	2.00	精製水	74.90
フィーン 20	2.00	香料、硬化防止剤および防腐剤	少 量
スパン 60	0.50	地 方 例 5 [ペニシングクリーム]	
		(成 分)	(重量部)

44

特

ガランギン	0.20	ミリスチン酸イソプロピル	5.00
メチルステアリン酸	8.00	スクワラン	4.00
ミツロウ	5.00	流動ペラフィン	40.00
セタノール	3.00	ポリオキシエチレンセチルエーテル	2.70
ラノリン	2.00	乳化剤	2.50
ミリスチン酸イソプロピル	6.00	プロピレングリコール	2.00
流動ペラフィン	7.00	精製水	23.00
オリーブ油	2.00	香料、硬化防止剤および防腐剤	少 量
乳化剤	5.50		
トリエタノールアミン	0.60	4 図面の簡単な説明	
プロピレングリコール	3.00	図面は実施例 1 および比較例 1 ~ 5 でえた各	
精製水	57.70	リニメント剤のチロジナーゼ活性阻害能力を示	
香料、硬化防止剤および防腐剤	少 量	すための着色度と時間との関係を示すグラフで	
地 方 例 6 [コールドクリーム]		ある。	
(成 分)	(重量部)		
ラヌチニン	0.10	特許出願人	三省製薬株式会社
ミツロウ	10.00	代理人	赤坂士
セレシン	7.00	副 日 本 家 大 事 務 所	西武士
白色ワセリン	3.00		
ラノリン	5.00		

45

特

